

脳循環・代謝改善剤

日本薬局方ニセルゴリン錠

ニセルゴリン錠5mg「アメル」

NICERGOLINE

承認番号	22600AMX00154
薬価収載	2014年6月
販売開始	2014年7月

規制区分: 処方箋医薬品 [※]
貯法: 室温保存
使用期限: 包装箱に表示。 使用期限を過ぎた製品 は使用しないこと。

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

頭蓋内出血後、止血が完成していないと考えられる患者
[出血を助長するおそれがある。]

【組成・性状】

1. 組成

販売名	ニセルゴリン錠5mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局ニセルゴリン5mgを含有する。
添加物	乳糖水和物、D-マンニトール、トウモロコシデンプン、マクロゴール6000、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、カルナウバロウ

2. 製剤の性状

販売名	剤形	色	外形・大きさ等	識別コード
ニセルゴリン錠5mg「アメル」	フィルムコーティング錠	白色	 直径: 約6.1mm 厚さ: 約3.1mm 質量: 約85.0mg	KW577

【効能・効果】

脳梗塞後遺症に伴う慢性脳循環障害による意欲低下の改善

【用法・用量】

ニセルゴリンとして、通常成人1日量15mgを3回に分けて経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤の投与期間は、臨床効果及び副作用の程度を考慮しながら慎重に決定するが、投与12週で効果が認められない場合には投与を中止すること。

【使用上の注意】

1. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。
以下のような副作用が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
消化器	食欲不振、下痢、便秘、悪心、腹痛、口渇
肝臓	肝機能障害
循環器	めまい、立ちくらみ、動悸、ほてり
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、耳鳴、不眠
過敏症	発疹、蕁麻疹、そう痒

2. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔動物実験(ラット)で次世代の発育抑制が報告されている。〕

(2)授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

4. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

5. 適用上の注意

薬剤交付時:

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

【薬物動態】

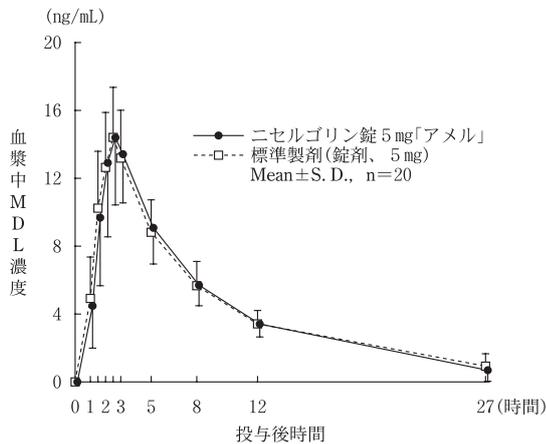
〈生物学的同等性試験〉¹⁾

ニセルゴリン錠5mg「アメル」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠(ニセルゴリンとして10mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して、血漿中主代謝物MDL(10-methoxy-6-methylergoline-8β-methanol)濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について95%信頼区間法にて統計解析を行った結果、±20%の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

(注)10mg単回投与は承認外用量である。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _(0-∞) (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ニセルゴリン錠5mg「アメル」	118.8±23.6	14.89±3.93	2.7±0.6	6.0±1.7
標準製剤(錠剤、5mg)	120.1±22.8	14.86±2.96	2.5±0.3	6.7±2.2

(Mean ± S. D., n = 20)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

〈溶出挙動〉²⁾

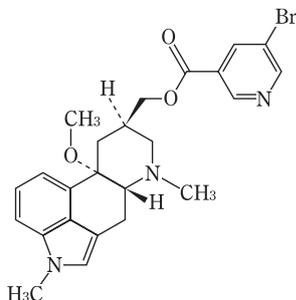
ニセルゴリン錠 5mg「アメル」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたニセルゴリン 5mg錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

脳循環改善薬。バツカクアルカロイドで、血流増大作用、血小板凝集抑制作用、赤血球変形能亢進作用、脳エネルギー代謝改善作用などを有することが示唆されている。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ニセルゴリン (Nicergoline)
 分子式：C₂₄H₂₆BrN₃O₃
 分子量：484.39
 構造式：



化学名：[(8R, 10S)-10-Methoxy-1, 6-dimethylergolin-8-yl] methyl 5-bromopyridine-3-carboxylate

性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。
 アセトニトリル、エタノール(99.5)又は無水酢酸にやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。
 光によって徐々に淡褐色となる。
 融点：約136℃(分解)。

【取扱い上の注意】

〈安定性試験〉⁴⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ニセルゴリン錠 5mg「アメル」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

**【包装】

PTP100錠(10錠×10)

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 共和薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験
- * 3) 第十七改正日本薬局方解説書、廣川書店、C-3724(2016)
- 4) 共和薬品工業株式会社 社内資料：安定性試験

〈文献請求先〉

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。
 共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口
 〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4
 ☎ 0120-041-189
 FAX 06-6121-2858

製造販売元
共和薬品工業株式会社
 大阪市北区中之島3-2-4